

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
17 février 2005 (17.02.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 2005/013957 A2

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
A61K 31/155, 9/16

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2004/050376

(22) Date de dépôt international : 5 août 2004 (05.08.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
0350403 6 août 2003 (06.08.2003) FR

(71) Déposants (pour tous les États désignés sauf US) : SARL  
GALENIX INNOVATIONS [FR/FR]; Allée des Palan-  
ques, F-33127 Saint-Jean D'Illac (FR). PHARMINNOVA-  
TION [FR/FR]; 2, allée du Doyen Brus, F-33600 Pessac  
(FR).

(72) Inventeur; et

(75) Inventeur/Déposant (pour US seulement) : BESSE,  
Jérôme [FR/FR]; Chemin des Vins Barbat, F-33480  
Listrac Medoc (FR).

(74) Mandataires : CATHERINE, Alain? etc.; 7, rue de  
Madrid, F-75008 Paris (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de  
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,  
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,  
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,  
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,  
MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,  
PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN,  
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre  
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,  
ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,  
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,  
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Déclaration en vertu de la règle 4.17 :

— relative à la qualité d'inventeur (règle 4.17.iv) pour US  
seulement

Publiée :

— sans rapport de recherche internationale, sera republiée  
dès réception de ce rapport

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-  
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et  
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de  
la Gazette du PCT.

(54) Title: SOLID DISPERSIBLE AND/OR ORODISPERSIBLE NON-FILMY CONTAINING AT LEAST ONE TYPE OF AC-  
TIVE SUBSTANCE PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND METHOD FOR THE PREPARATION THEREOF

(54) Titre : COMPOSITION PHARMACEUTIQUE SOLIDE DISPERSIBLE ET/OU ORODISPERSIBLE NON PELLICULEE  
CONTENANT AU MOINS LE PRINCIPE ACTIF METFORMINE, BT PROCEDE DE PREPARATION

(57) Abstract: The invention relates to a solid dispersible and orodispersible instantly releasing pharmaceutical composition which  
is present in a aqueous medium in the form of particles whose shape is less than 710 µm, contains at least one type of metformin  
active substance and is characterised in that it comprises: a) 65-90 mass % metformin active substance possibly in the form of a  
salt or a combination of said metformin active substance and a hypoglycaemic active substance; b) 0.5-4 mass % binding agent or  
a combination of binding agents; c) 1-12 mass % disintegrator or a combination of disintegrators; d) 0-10 mass % diluting agent or  
a combination of diluting agents; e) 0.05-3 mass % sweetening agent or a combination of sweetening agents and f) one or several  
additional excipients, the mass percentages being expressed with respect to the total mass of said composition.

(57) Abrégé : L'invention concerne une composition pharmaceutique solide dispersible et orodispersible à libération immédiate  
se présentant en milieu aqueux sous la forme de particules d'une taille inférieure à 710 µm, contenant au moins le principe actif  
metformine, caractérisée en ce qu'elle comprend : a) de 65% à 90% en poids du principe actif metformine, éventuellement sous la  
forme d'un sel, ou d'une combinaison du principe actif metformine avec un principe actif hypoglycémiant ; b) de 0,5 à 4% en poids  
d'un agent liant ou d'une combinaison d'agents liants ; c) de 1 % à 12% en poids d'un agent désintégrant ou d'une combinaison d'agents  
désintégrants ; d) de 0% à 10% en poids d'un agent diluant ou d'une combinaison d'agents diluants ; e) de 0,05% à 3% en poids d'un  
agent édulcorant ou d'une combinaison d'agents édulcorants ; et f) un ou plusieurs excipients additionnels, les pourcentages en poids  
étant exprimés par rapport au poids total de ladite composition.

WO 2005/013957 A2

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
17 février 2005 (17.02.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 2005/013957 A3

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
A61K 31/155, 9/16, 9/20

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2004/050376

(22) Date de dépôt international : 5 août 2004 (05.08.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
0350403 6 août 2003 (06.08.2003) FR

(71) Déposants (pour tous les États désignés sauf US) : SARL  
GALENIX INNOVATIONS [FR/FR]; Allée des Palan-  
ques, F-33127 Saint-Jean D'Illac (FR). PHARMINNOVA-  
TION [FR/FR]; 2, allée du Doyen Brus, F-33600 Pessac  
(FR).

(72) Inventeur; et

(75) Inventeur/Déposant (pour US seulement) : BESSE,  
Jérôme [FR/FR]; Chemin des Vins Barbat, F-33480  
Listrac Medoc (FR).

(74) Mandataires : CATHERINE, Alain etc.; 7, rue de  
Madrid, F-75008 Paris (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de  
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,

AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,  
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,  
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,  
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,  
MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,  
PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN,  
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre  
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,  
ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,  
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,  
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Déclaration en vertu de la règle 4.17 :

— relative à la qualité d'inventeur (règle 4.17.iv)) pour US  
seulement

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale

(88) Date de publication du rapport de recherche  
internationale: 26 mai 2005

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-  
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et  
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de  
la Gazette du PCT.

(54) Title: SOLID DISPERSIBLE AND/OR ORODISPERSIBLE NON-FILMY CONTAINING AT LEAST ONE TYPE OF AC-  
TIVE SUBSTANCE PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND METHOD FOR THE PREPARATION THEREOF

(54) Titre : COMPOSITION PHARMACEUTIQUE SOLIDE DISPERSIBLE ET/OU ORODISPERSIBLE NON PELLICULEE  
CONTENANT AU MOINS LE PRINCIPE ACTIF METFORMINE, ET PROCEDE DE PREPARATION

(57) Abstract: The invention relates to a solid dispersible and orodispersible instantly releasing pharmaceutical composition which  
is present in a aqueous medium in the form of particles whose shape is less than 710 µm, contains at least one type of metformin  
active substance and is characterised in that it comprises: a) 65-90 mass % metformin active substance possibly in the form of a  
salt or a combination of said metformin active substance and a hypoglycaemic active substance; b) 0.5-4 mass % binding agent or  
a combination of binding agents; c) 1-12 mass % disintegrator or a combination of disintegrators; d) 0-10 mass % diluting agent or  
a combination of diluting agents; e) 0.05-3 mass % sweetening agent or a combination of sweetening agents and f) one or several  
additional excipients, the mass percentages being expressed with respect to the total mass of said composition.

(57) Abrégé : L'invention concerne une composition pharmaceutique solide dispersible et orodispersible à libération immédiate  
se présentant en milieu aqueux sous la forme de particules d'une taille inférieure à 710 µm, contenant au moins le principe actif  
metformine, caractérisée en ce qu'elle comprend : a) de 65% à 90% en poids du principe actif metformine, éventuellement sous la  
forme d'un sel, ou d'une combinaison du principe actif metformine avec un principe actif hypoglycémiant ; b) de 0,5 à 4% en poids  
d'un agent liant ou d'une combinaison d'agents liants ; c) de 1 % à 12% en poids d'un agent désintégrant ou d'une combinaison d'agents  
désintégrants ; d) de 0% à 10% en poids d'un agent diluant ou d'une combinaison d'agents diluants ; e) de 0,05% à 3% en poids d'un  
agent édulcorant ou d'une combinaison d'agents édulcorants ; et f) un ou plusieurs excipients additionnels, les pourcentages en poids  
étant exprimés par rapport au poids total de ladite composition.

WO 2005/013957 A3

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/FR2004/050376

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A61K31/155 A61K9/16 A61K9/20

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, MEDLINE, EMBASE, BIOSIS

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 01/35941 A (LILLIOTT NICOLA JAYNE ;LEWIS KAREN (GB); MACKENZIE DONALD COLIN (G) 25 May 2001 (2001-05-25) page 2, line 30 - line 33 page 6, lines 18-21 page 7, line 20 - page 8, line 5 examples 17,18 claims 1,6,8	1-31
A	US 6 358 526 B1 (MERGENS WILLIAM J ET AL) 19 March 2002 (2002-03-19) column 5, line 44 - line 58 column 10, line 12 - line 21 column 11, line 8 - line 21 column 12, line 1 - line 12 column 12, line 25 claim 1	1-31

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*G\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

10 February 2005

Date of mailing of the international search report

25/02/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hedegaard, A

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/FR2004/050376

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 02/47607 A (MALIK RAJIV ;MURPANI DEEPAK (IN); RANBAXY LAB LTD (IN)) 20 June 2002 (2002-06-20) claims 1-5,8,16-21 -----	1-31
A	WO 03/051293 A (DESAI DIVYAKANT S ;SQUIBB BRISTOL MYERS CO (US); LI DANPING (US);) 26 June 2003 (2003-06-26) tables 1,2 example 1 -----	1-31
A	US 6 100 300 A (ROGOSKY KAREN M) 8 August 2000 (2000-08-08) column 3, line 59 - column 5, line 15 examples 1,2 -----	1-31
A	US 6 117 451 A (KUMAR VIJAI) 12 September 2000 (2000-09-12) cited in the application the whole document -----	1-31

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/FR2004/050376

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0135941	A	25-05-2001	AU 775654 B2	12-08-2004
			AU 1404001 A	30-05-2001
			BG 106747 A	31-01-2003
			BR 0015605 A	09-07-2002
			CA 2388846 A1	25-05-2001
			CN 1414852 T	30-04-2003
			EA 4878 B1	26-08-2004
			EP 1231918 A2	21-08-2002
			WO 0135941 A2	25-05-2001
			HR 20020416 A2	31-08-2004
			HU 0204122 A2	28-03-2003
			JP 2003514012 T	15-04-2003
			MA 25567 A1	01-10-2002
			MX PA02005005 A	14-10-2003
			NO 20022334 A	09-07-2002
			NZ 518946 A	31-10-2003
			PL 355331 A1	19-04-2004
			SK 6792002 A3	10-09-2002
			ZA 200203865 A	22-11-2002
US 6358526	B1	19-03-2002	AU 7312201 A	25-02-2002
			BR 0113305 A	15-07-2003
			CA 2354639 A1	16-02-2002
			EP 1309314 A2	14-05-2003
			JP 2004506007 T	26-02-2004
			WO 0213793 A2	21-02-2002
			US 2002150617 A1	17-10-2002
WO 0247607	A	20-06-2002	AU 2096802 A	24-06-2002
			EP 1343481 A2	17-09-2003
			WO 0247607 A2	20-06-2002
WO 03051293	A	26-06-2003	US 2003139461 A1	24-07-2003
			AU 2002357095 A1	30-06-2003
			CA 2470581 A1	26-06-2003
			EP 1455793 A2	15-09-2004
			WO 03051293 A2	26-06-2003
US 6100300	A	08-08-2000	NONE	
US 6117451	A	12-09-2000	NONE	



# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande Internationale No  
PCT/FR2004/050376

**A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE**

CIB 7 A61K31/155 A61K9/16 A61K9/20

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

**B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE**

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)

CIB 7 A61K

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, MEDLINE, EMBASE, BIOSIS

**C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS**

Catégorie *	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
X	WO 01/35941 A (LILLIOTT NICOLA JAYNE ; LEWIS KAREN (GB); MACKENZIE DONALD COLIN (G) 25 mai 2001 (2001-05-25) page 2, ligne 30 - ligne 33 page 6, ligne 18-21 page 7, ligne 20 - page 8, ligne 5 exemples 17,18 revendications 1,6,8 -----	1-31
A	US 6 358 526 B1 (MERGENS WILLIAM J ET AL) 19 mars 2002 (2002-03-19) colonne 5, ligne 44 - ligne 58 colonne 10, ligne 12 - ligne 21 colonne 11, ligne 8 - ligne 21 colonne 12, ligne 1 - ligne 12 colonne 12, ligne 25 revendication 1 ----- -/--	1-31



Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents



Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe

\* Catégories spéciales de documents cités:

- \*A\* document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent
- \*E\* document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date
- \*L\* document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)
- \*O\* document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens
- \*P\* document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée

- \*T\* document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention
- \*X\* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément
- \*Y\* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier
- \*Z\* document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

10 février 2005

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

25/02/2005

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale

Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Hedegaard, A

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande Internationale No

PCT/FR2004/050376

## C.(suite) DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie *	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	WO 02/47607 A (MALIK RAJIV ;MURPANI DEEPAK (IN); RANBAXY LAB LTD (IN)) 20 juin 2002 (2002-06-20) revendications 1-5,8,16-21 -----	1-31
A	WO 03/051293 A (DESAI DIVYAKANT S ;SQUIBB BRISTOL MYERS CO (US); LI DANPING (US);) 26 juin 2003 (2003-06-26) tableaux 1,2 exemple 1 -----	1-31
A	US 6 100 300 A (ROGOSKY KAREN M) 8 août 2000 (2000-08-08) colonne 3, ligne 59 - colonne 5, ligne 15 exemples 1,2 -----	1-31
A	US 6 117 451 A (KUMAR VIJAI) 12 septembre 2000 (2000-09-12) cité dans la demande le document en entier -----	1-31

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Renseignements relatifs aux membres de familles de brevets

Demande Internationale No

PCT/FR2004/050376

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO 0135941	A	25-05-2001	AU 775654 B2	12-08-2004
			AU 1404001 A	30-05-2001
			BG 106747 A	31-01-2003
			BR 0015605 A	09-07-2002
			CA 2388846 A1	25-05-2001
			CN 1414852 T	30-04-2003
			EA 4878 B1	26-08-2004
			EP 1231918 A2	21-08-2002
			WO 0135941 A2	25-05-2001
			HR 20020416 A2	31-08-2004
			HU 0204122 A2	28-03-2003
			JP 2003514012 T	15-04-2003
			MA 25567 A1	01-10-2002
			MX PA02005005 A	14-10-2003
			NO 20022334 A	09-07-2002
			NZ 518946 A	31-10-2003
			PL 355331 A1	19-04-2004
			SK 6792002 A3	10-09-2002
			ZA 200203865 A	22-11-2002
US 6358526	B1	19-03-2002	AU 7312201 A	25-02-2002
			BR 0113305 A	15-07-2003
			CA 2354639 A1	16-02-2002
			EP 1309314 A2	14-05-2003
			JP 2004506007 T	26-02-2004
			WO 0213793 A2	21-02-2002
			US 2002150617 A1	17-10-2002
WO 0247607	A	20-06-2002	AU 2096802 A	24-06-2002
			EP 1343481 A2	17-09-2003
			WO 0247607 A2	20-06-2002
WO 03051293	A	26-06-2003	US 2003139461 A1	24-07-2003
			AU 2002357095 A1	30-06-2003
			CA 2470581 A1	26-06-2003
			EP 1455793 A2	15-09-2004
			WO 03051293 A2	26-06-2003
US 6100300	A	08-08-2000	AUCUN	
US 6117451	A	12-09-2000	AUCUN	